特許協力条約

РСТ

特許性に関する国際予備報告(特許協力条約第二章)

(法第 12 条、法施行規則第 56 条) [PCT36 条及びPCT規則 70]

REC'D	2	2	DEC	2005
WIPO				PCT

出願人又は代理人 の書類記号 YCT-1004	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。					
国際出願番号 PCT/JP2005/001749	国際出願日 (日. 月. 年) 07. 02. 2005	優先日 (日.月.年) 06.02.2004				
国際特許分類(IPC)Int.Cl. A61K31/593, 9/08, 9/48, 47/10, 47/22, 47/44, A61P19/10						
出願人(氏名又は名称) 中外製薬株式会社						

中外製薬株式会社						
1. この報告書は、PCT35 条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。 法施行規則第 57 条(PCT36 条)の規定に従い送付する。						
2.この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で4 ページからなる。						
3. この報告には次の附属物件も添付されている。 a 附属書類は全部で ページである。						
補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面の用紙(PCT規則 70.16 及び実施細則第 607 号参照)						
第 I 欄 4. 及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの 国際予備審査機関が認定した差替え用紙						
b. 電子媒体は全部で 配列表に関する補充欄に示すように、電子形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。 (実施細則第802号参照)						
4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。						
 ▼ 第 I 欄 国際予備審査報告の基礎 第 II 欄 優先権 第 II 欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成 第 IV 欄 発明の単一性の欠如 第 V欄 P C T 35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明 						
□ 第VI欄 ある種の引用文献 □ 第VII欄 国際出願の不備 □ 第VII欄 国際出願に対する意見						

国際予備審査の請求書を受理した日 15.02.2005	国際予備審査報告を作成した日 07.12.2005
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP)	特許庁審査官(権限のある職員) ・安藤 , 倫世
郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	電話番号 03-3581-1101 内線 3492

第 I	欄	報告の基礎
٦		
1.	gume.	山原中の子等にとる国際出願
	P	出願時の言語による国際出願 出願時の言語から次の目的のための言語である 語に翻訳された、この国際出願の翻訳文
	L.	国際調査 (PCT規則12.3(a)及び23.1(b))
		国際公開 (PCT規則12.4(a))
		国際予備審査 (PCT規則55.2(a)又は55.3(a))
0	- σ	D報告は下記の出願書類を基礎とした。 (法第6条 (PCT14条) の規定に基づく命令に応答するために提出され
۷,	た差	を替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)
	,	出願時の国際出願書類
	V	山旗中少国际山源南海
		明細書
		第 ページ、出願時に提出されたもの 付けで国際予備審査機関が受理したもの
İ		第 ページ*、 付けで国際予備審査機関が受理したもの
		第 ページ*、 付けで国際予備審査機関が受理したもの 第 ページ*、 付けで国際予備審査機関が受理したもの
	Re mi	項、出願時に提出されたもの
Ì		第 項*、FCTT9米の規定に置いています。 第 項*、 付けで国際予備審査機関が受理したもの 第 項*、 付けで国際予備審査機関が受理したもの
ļ		第 <u></u>
		「図面 NET
		第 ペーシ/図、 出願時に提出されたもの
		第 ページ/図、出願時に提出されたもの 第 ページ/図*、 付けで国際予備審査機関が受理したもの 第 ページ/図*、 付けで国際予備審査機関が受理したもの
1		
		ご 配列表又は関連するテーブル 配列表に関する補充欄を参照すること。
3.	Г	補正により、下記の書類が削除された。
	P.444	
		明細書 第 ページ 請求の範囲 第 項 ページ/図 ページ/図
1		請求の範囲
		配列表(具体的に記載すること)
		■ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること)
4	r	この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を制 「RC T
7	• #	この報告は、補允欄に示したように、この報告に続けてものとして作成した。 (PCT規則 70.2(c)) えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。 (PCT規則 70.2(c))
		■ 明細書 第 ページ
		ま求の範囲 第 項
		第
1		□ 配列表(具体的に記載すること)□ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること)
		配列表に関連するアーノル(果仲別に記載すること/
*	k 4.	. に該当する場合、その用紙に "superseded" と記入されることがある。
1	~ •	

第1	7欄 新規性、進歩性又は産業上の それを裏付ける文献及び説	の利用可能性についての法第 12 条(P C T 35 条 (2))に定める兄舺、 明	
1.	見解		
	新規性(N)	請求の範囲 1-10 請求の範囲	有 無
	進歩性(IS)	請求の範囲 請求の範囲 <u>1-10</u>	有 無
	産業上の利用可能性(IA)	請求の範囲 1-10 :: : : : : : : : : : : : : : : : : :	有 無

2. 文献及び説明 (PCT規則 70.7)

文献 1 : JP 2002-505668 A (ウィメン アント インファンツ ホスヒ タル) 2002. 02. 19 & WO 98/51678 A1 & C A 2289209 A & AU 9874936 A & AU 743514 B & EP 981523 A1 & US 6100294 A & US 612131 2 A & US 6479538 B1 & US 2003/125309 A1

文献 2: JP 63-107929 A (中外製薬株式会社) 1988.05.12 ファミリーなし

文献 3: JP 10-072432 A (中外製薬株式会社) 1998.03.17 & CA 2259339 A & AU 9731073 A & EP 924199 A1 & CN 1223639 A & IL 127861 A & US 2002/111503 A1 & US 6448421 B2 & KR 2000022113 A & US 2003/018206 A1 & US 6831183 B2 & US 2005/009794 A1 & WO 98/00 397 A1

文献4: JP 06-087750 A (大洋薬品工業株式会社) 1994.03.29 ファミリーなし

文献 5: JP 05-004925 A (帝国化学産業株式会社) 1993.01.14 ファミリーなし

文献 6: JP 02-215765 A (株式会社ほくさん) 1990.08.28 ファミリーなし

文献 7 : JP 06-041060 A (デ゛ュファー・インターナショナル・リサーチ・ヘ゛ー・フ゛イ) 1994. 02. 15 & EP 558119 A2 &

ES 2140433 T3 & CA 2090264 A & US 5304291 A & IL 104844 A

文献 8: WO 01/090061 A1 (中外製薬株式会社) 2001.11.29 & AU 2001056791 A & EP 12842

59 A1 & US 2003/092687 A1 & US 2005/032754 A1

補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

第 V 欄の続き

[1]請求の範囲1-9に記載された発明は、国際調査報告で引用された上記文献1-7により進歩性を有しない。

文献 1-3には、有用な生理活性を有する活性型ビタミンD $_3$ 誘導体として、(5 Z, 7 E) $-(1\,\mathrm{R},\ 2\,\mathrm{R},\ 3\,\mathrm{R})$ -2-(3-ビドロキシプロポキシ)-9, 10-セココレスタ 5, 7, 10 (19) -トリエン-1, 3, 25-トリオール(以下、「ED-71」とする)が記載されており、文献 1 及び 2 には、組成物とする際に油脂と安定化剤を含むことが、文献 1 には添加し得る抗酸化剤が、記載されている(文献 1 第 29-31 頁、文献 2 第 5 頁参照)。

一方、一般に、活性型ビタミンD $_3$ 誘導体は光等に対して不安定で酸化され易く、油剤と抗酸化剤とで有効に安定化し得ることが知られており、文献 $_4$ 及び $_5$ には、好適な添加量についても、記載されている(文献 $_4$ 全文、文献 $_5$ 全文参照)。

そうしてみると、ED-71についても、同様の方法で安定化することは当業者が容易に行い得ることである。

また、安定化の結果として、ビタミンD体のトランス異性体、タキステロール型異性体等(必要であれば文献3第3頁、文献6第3頁、文献7第3頁等参照)、不純物の生成が抑制されることは当然の結果であり、これを格別の効果とすることはできない。

[2]請求の範囲10に記載された発明は、国際調査報告で引用された上記文献1-8により 進歩性を有しない。

上記[1]参照。

文献1-3には、有用な生理活性を有する活性型ビタミンD $_3$ 誘導体として、ED-71が記載されている。

文献 8 には、公知の 5 Z配置のビタミンD $_3$ 誘導体に対して、 5 E配置の異性体を合成し、生理活性を検討することが記載されており(文献 8 第 6 頁参照)、文献 6 には光反応でシスートランス変換を行い得ることも記載されている(文献 6 第 3 頁参照)。

そうしてみると、ED-71についても、同様にトランス体を想到することは、当業者が容易に行い得ることである。